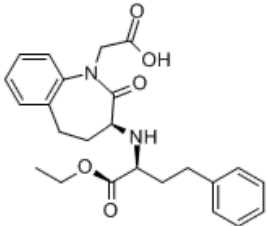




本PDF文件由 爱化学 iChemistry.cn 免费提供, 全部信息请点击[86541-75-5](#), 若要查询其它化学品请登录[CAS号查询网](#)

如果您觉得本站对您的学习工作有帮助, 请与您的朋友一起分享:) [爱化学www.iChemistry.cn](#)

CAS Number:86541-75-5 基本信息

中文名:	贝那普利; (3s)-3-[[[(1s)-1-乙氧羰基]-3-苯基丙基]氨基]-2,3,4,5-四氢-2-氧代-1H-1-苯并氮卓-1-乙酸
英文名:	Benazepril
别名:	(3S)-3-[[[(1S)-1-(Ethoxycarbonyl)-3-phenylpropyl]amino]-2,3,4,5-tetrahydro-2-oxo-1H-1-benzazepine-1-acetic acid; 2-[(4S)-4-[[[(1S)-1-ethoxycarbonyl-3-phenyl-propyl]amino]-5-oxo-6-azabicyclo[5.4.0]undeca
分子结构:	
分子式:	C ₂₄ H ₂₈ N ₂ O ₅
分子量:	424.49
CAS登录号:	86541-75-5

安全信息

安全说明:	S22: 不要吸入粉尘。 S24/25: 防止皮肤和眼睛接触。
-------	------------------------------------

CAS#86541-75-5化学试剂供应商(点击生产商链接可查看价格)

供应商信息已更新, 请登录爱化学 [CAS No. 86541-75-5 查看](#)
如果您是此化学品供应商, 请按照[化工产品收录](#)说明进行免费添加

其他信息

产品应用:	贝那普利(86541-75-5)的用途: 前体药物, 吸收迅速, 主要在肝脏中转换为有活性的代谢物贝那普利拉而发挥抑制血管紧张素作用。用于高血压。
生产方法及其他:	贝那普利(86541-75-5)的生产方法: 2-氨基-4-(2-氨基苯基)丁酸乙酯环合, 得到的化合物和溴乙酸苄酯作用, 再氢解, 最后和α-氧代苯丁酸乙酯进行还原氨化, 得贝那普利。 化合物(I)环合得到化合物(II), 和溴乙酸苄酯作用得化合物(III)。(III)氢解得化合物(IV), 再和化合物(V)进行还原氨化, 得贝那普利。 化合物(V)可以先在辛可尼丁(cinchonidine)存在下, 氢化还原得到化合物(VI), 收率约95%, 光学选择性为70%。用对硝基苯磺酰氯酰化, 得活性的磺酸酯(VII)。(VII)和化合物(IV)和叔丁酯在N-甲基吗啉中反应, 即得贝那普利。

贝那普利(86541-75-5)的药理:

本品为血管紧张素转换酶抑制药,在体内转换成贝那普利拉后生效。原药抑制血管紧张素转换酶活性的作用仅为后者的千分之一。本品特点为出现作用慢,但维持作用时间长,对心功能指标有良好改善作用,能改善充血性心力衰竭的临床症状及运动能力。

贝那普利(86541-75-5)的药动学:

1. 吸收:

[盐酸](#)苯那普利口服后迅速吸收,30分钟后原形苯那普利血浆浓度达峰值。通过测定尿液中原药与其代谢物的含量,确定其吸收量至少是服药剂量的37%。盐酸苯那普利片中苯那普利拉的绝对生物利用度为静脉注射苯那普利拉溶液生物利用度的27%。

进食后服药,延迟苯那普利的吸收,但不影响吸收量和转变为苯那普利拉。故洛汀新可以餐中或两餐间服用。

在5~20mg剂量范围内,苯那普利和苯那普利拉的AUC和血浆浓度峰值与剂量的大小约成正比。

2. 分布:

苯那普利和苯那普利拉与血清蛋白(主要是白蛋白)的结合率约95%。

3. 代谢:

前体药苯那普利快速完全转换成有药理活性的代谢物苯那普利拉,90分钟后血浆浓度达峰值。肝脏中的[水](#)解酶主要参与了这种转换。

4. 消除:

苯那普利的药代动力学特点是从血浆中迅速消除(4小时内完全消除)苯那普利拉分两个阶段消除。终末消除期(从第24小时起)提示苯那普利拉和ACE的牢固结合。

苯那普利主要经过代谢消除,苯那普利拉主要经肾和胆汁消除。肾功能正常的病人主要经肾脏消除。苯那普利拉的代谢消除是次要途径。口服盐酸苯那普利后,尿中仅发现不到1%的原形苯那普利。20%以苯那普利拉形式从尿中排出。另外两种代谢物为苯那普利和苯那普利拉的乙酰-葡萄糖苷酸的结合物。

服用盐酸苯那普利2小时以后,常规的血液透析对血浆苯那普利和苯那普利拉浓度无影响。所以透析后无需补充药物。只有小部分苯那普利拉通过透析排出体外。

心衰病人中苯那普利拉的稳态血药浓度常常高于健康人或高血压病人,这表明心衰病人血浆清除率低。因此,心衰病人推荐的起始剂量要低于高血压病人。

与下列药物合用时洛汀新的药代动力学不受影响:[氢氯噻嗪](#),呋塞米,氯噻酮,地高辛,[普萘洛尔](#),阿替洛尔,硝苯地平,羧普生,[乙酰水杨酸](#)和西米替丁。同样,洛汀新也不影响这些药物的药代动力学(西米替丁的药代动力学未曾研究)。

贝那普利(86541-75-5)的适应症:

1. 本品适用于轻、中度高血压病的治疗,疗效与卡托普利、依那普利、硝苯地平、尼群地平、普萘洛尔等药物用常用量治疗时相同。目前作为高血压病治疗的二线药。

2. 各期高血压。

3. 充血性心力衰竭。

4. 作为对洋地黄和/或利尿剂反应不佳的充血性心力衰竭病人的辅助治疗。

贝那普利(86541-75-5)的用法及用量:

初始剂量为每日10mg,若不能获得满意效果,可增加至20mg。宜将每日总剂量等分为二次服用,或与利尿

剂并用。推荐的最高日剂量为40mg，一次服用，或一日2次分服。

贝那普利(86541-75-5)的禁用慎用：

对本品过敏、有血管神经性水肿史者忌用。肾衰病人(肌酐清除率<30ml/min)应使用低剂量。

患主动脉瓣狭窄及二尖瓣狭窄的病人用任何血管扩张剂时都应特别小心。

与使用所有ACE抑制剂相同，肾动脉狭窄患者需特别注意。少数人服用洛汀新后血液尿素氮和血清肌酐增高，停用洛汀新或利尿剂，或二者同时停用，即可恢复。对这类及其它肾脏病患者，在洛汀新治疗的头几周要密切监测肾功能，以后应定期检查肾功能。

严重心力衰竭、冠状动脉或脑动脉硬化患者慎用。

老年患者使用洛汀新与年轻人一样，有较好疗效和耐受性。但与所有降压药一样，老年患者及其伴心衰、冠状动脉及脑动脉硬化患者使用时均应注意。血压的突然降低可引起重要器官的供血不足。

用洛汀新的患者，中枢神经症状的反应很少见，与其它降压药一样，患者在驾驶和操纵机器时要注意这些影响。

用高通透性聚丙烯睛膜(AN69)透析的患者，使用ACE抑制剂时有过敏样反应的报道。因此，建议用ACE抑制剂的病人不使用这类膜透析。

妊娠期不用洛汀新，在妊娠期的前6个月用洛汀新可导致胎儿肾损害，脸及头颅畸形。并且也存在胎儿低血压的危险。新生儿可出现低体重、肾灌注减少及无尿。有报道孕妇羊水过少，推测与胎儿肾功能受损有关。所有在宫内期间母亲接受过洛汀新治疗的新生儿，应仔细检查有无高血钾，尿量及血压是否正常。必要时，应采取适当措施。例如补液或透析清除循环中的ACE抑制剂。

贝那普利(86541-75-5)的不良反应：

发生率约20%。主要为头痛、头晕、乏力、咳嗽、恶心、失眠、体位性低血压、面部及唇部肿胀、肌痛、鼻炎、咽炎、呼吸道阻塞和背痛等。

少数病人给予本品后血中尿素氮和血清肌酐升高，停用本品后即可自行恢复。

服用本品罕见血钾升高。但肾功能不全、糖尿病以及同时使用治疗低血钾的药物可能是导致出现高血钾的因素。

贝那普利(86541-75-5)的相互作用：

本品与利尿药、钙拮抗药或β受体阻滞药合用可增强降压效果。

用ACE抑制剂患者应避免与保钾利尿剂(如螺内酯、氨苯蝶啶及阿米洛利等药)合用，以及避免补钾或补含钾的电解质溶液。因为这可能导致血清钾显著增加。若必须合用，则应密切监测血清钾。

相关化学品信息

[86475-43-6](#) [865-40-7](#) [864082-33-7](#) [866144-02-7](#) [861316-90-7](#) [869653-90-7](#) [864759-58-0](#) [1-\[2-\(2,4-二氟苯基\)-2,3-环氧丙烷\]-1H-1,2,4-三氮唑甲磺酸盐](#) [869-01-2](#) [86988-49-0](#) [861071-98-9](#) [864071-82-9](#) [86423-37-2](#) [869856-83-7](#) [月桂酰胺丙基甜菜碱](#) 474

生成时间2021/3/24 11:56:46